

PR-81

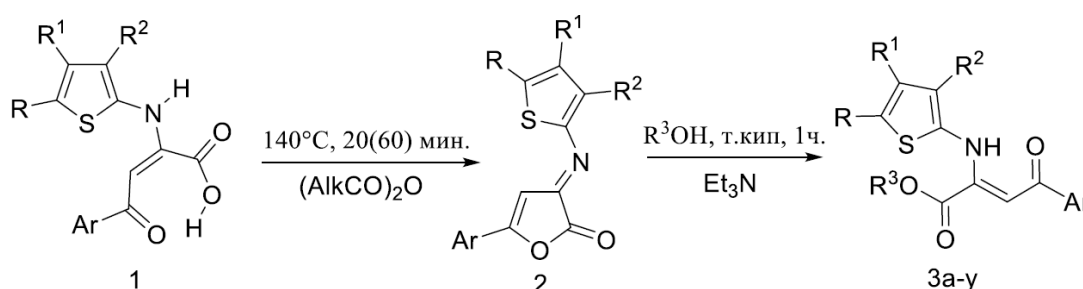
ЗАВИСИМОСТЬ АНАЛЬГЕТИЧЕСКОЙ АКТИВНОСТИ АЛКИЛОВЫХ ЭФИРОВ 4-АРИЛ-4-ОКСО-2-ТИЕНИЛАМИНОБУТ-2-ЕНОВЫХ КИСЛОТ ОТ ИХ СТРУКТУРЫ

А. Ю. Васильева, С. А. Шипиловских, Р. Р. Махмудов, Е. В. Бабушкина, А. Е. Рубцов

ФГБОУ ВО «Пермский государственный национальный исследовательский университет»,
614990, Россия, г. Пермь, ул. Букирева, 15,
E-mail: vasilovaay@psu.ru

Группой коллег ранее было обнаружено, что 4-арил-4-оксо-2-тиениламинобут-2-еновые кислоты обладают анальгетической активностью на уровне или выше референтных соединений¹. С целью поиска соединений, обладающих биологической активностью, превышающей уже известные 2-тиениламинобут-2-еновые кислоты 1, нами были получены алкиловые эфиры 4-арил-4-оксо-2-тиениламинобут-2-еновых кислот 3, также показывающие высокую анальгетическую активность².

Расширение ряда эфиров тиениламинобутеновых кислот и изучение их активности позволило вывести математическую зависимость «структура-активность» для ряда синтезированных веществ.



3: R₂=COOEt, R+R₁=(CH₂)₄, Ar=Ph, R₃=Et(a); Ar=4-MeC₆H₄, R₃=Me(б), Et(в), Pr(г), i-Pr(д); Ar=4-MeOC₆H₄, R₃=Me(е), Et(ж), Pr(з); Ar=4-ClC₆H₄, R₃=Me(и), Et(к); R₂=CONH₂, R+R₁=(CH₂)₄, Ar=4-MeC₆H₄, R₃=Me(л), Et(м), Pr(н), C₆H₁₁(о); Ar=4-MeOC₆H₄, R₃=Me(п), Et(р), Pr(с), i-Pr(т); Ar=4-ClC₆H₄, R₃=i-Pr(у).

Полученная зависимость дает возможность синтезировать в дальнейшем среди соединений этого ряда высоко биологически активное соединение-лидер.

Библиографический список

1. Synthesis and Analgesic Activity of Substituted 4-(Het)aryl-4-oxo-2-thienylaminobut-2-enoic Acids/ S. A. Shipilovskikh, R. R. Makhmudov, D. Y. Lupach [et al.]// Pharmaceutical Chemistry Journal. – 2013. – Vol. 47(7). – P. 366–370.
2. Поиск анальгетической активности среди продуктов взаимодействия амидов и этиловых эфиров 2-[5-Het(Ar)-2-оксофуран-3(2H)-илиденамино]-4,5,6,7-тетрагидробензо[β]тиофен-3-карбоновой кислоты с алифатическими спиртами / А. Ю. Васильева, С. А. Шипиловских, Р. Р. Махмудов и др.// Вестник Пермской государственной фармацевтической академии. – 2015. – Вып. 16. – С. 27–29